

WPI / Thomson

AN - 1992-364102 [44]
 AP - SU19762346430 19760402
 CN - R23426-U
 CPY - VITA-R
 DC - B02
 DCR - [1] 135269 USE
 DW - 199244
 IN - ALEKSEEVA ZH P; KLEMENTEVA I V; SMIRNOVA T N
 LNKA- 1992-161844
 M2 - [01] D013 D019 D023 E270 G010 G019 G100 H1 H181 H2 H201 H211 J0 J014
 J2 J232 J3 J371 J5 J522 L9 L910 M210 M211 M240 M262 M282 M314 M321
 M332 M344 M383 M391 M412 M511 M520 M533 M540 M781 M903 M904 P420 P522
 P814 P816 P943 V0 V322; R23426-U
 MC - B03-C B12-A07 B12-F01B B12-F06 B12-G02 B12-H05
 PA - (VITA-R) VITAMNINE INST
 PN - SU1701321 A1 19911230 DW199244
 PR - SU19762346430 19760402
 XIC - A61K-031/519; A61K-031/525
 AB - 'Benzaflavin' (sic) was recommended by the Pharmacological Committee
 of the Soviet Health Ministry for the treatment or prophylaxis of
 ischaemic heart disease, atherosclerosis symptoms, fatty degeneration,
 as part of non-insulin-dependent diabetes therapy, and in chronic
 pancreatitis and chronic dermatoses therapy. Its principal effect is
 to normalise the carbohydrate, lipid and protein exchange systems.
 The cpd., namely 2',3',4',5'-tetrabenzoyl-5-acetyl-
 1,5-dihydroriboflavin (C47H40O11N4) of formula (I), is a pale yellow
 substance, readily soluble in organic solvents. In tests, it was found
 to be non-toxic to mice when administered in 200-400 times the
 therapeutic dose.
 - USE :
 In vitamin B2 deficiency-related disorders. Bul.48/30.12.91
 .D
 ICAI- A61K31/525
 ICCI- A61K31/519
 INW - ALEKSEEVA ZH P; KLEMENTEVA I V; SMIRNOVA T N
 IW - TETRA BENZOYL ACETYL RIBOFLAVIN DERIVATIVE HYPOLIPAEMIC ANTI SCLEROTIC
 PREPARATION TREAT DISEASE ASSOCIATE VITAMIN=B2 DEFICIENT EXCHANGE
 DISORDER
 IWW - TETRA BENZOYL ACETYL RIBOFLAVIN DERIVATIVE HYPOLIPAEMIC ANTI SCLEROTIC
 PREPARATION TREAT DISEASE ASSOCIATE VITAMIN=B2 DEFICIENT EXCHANGE
 DISORDER
 NC - 1
 NPN - 1
 OPD - 1976-04-02
 PAW - (VITA-R) VITAMNINE INST
 PD - 1991-12-30
 TI - Tetra:benzoyl-acetyl-riboflavin deriv. - used as hypolipidaemic
 anti-sclerotic prepn. in treatment of diseases associated with
 vitamin=B2 deficiency or exchange disorder



СОЮЗ СОВЕТСКИХ
СОЦИАЛИСТИЧЕСКИХ
РЕСПУБЛИК

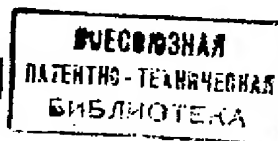
(19) **SU** (11) **1701321**

A1

(51)5 A 61 K 31/525

ГОСУДАРСТВЕННЫЙ КОМИТЕТ
ПО ИЗОБРЕТЕНИЯМ И ОТКРЫТИЯМ
ПРИ ГИИТ СССР

ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ И АВТОРСКОМУ СВИДЕТЕЛЬСТВУ



(21) 2346430/14
(22) 02.04.76
(46) 30.12.91. Бюл. № 48
(71) Всесоюзный научно-исследовательский
витаминовый институт
(72) И. В. Клементьева, Т. Н. Смирнова,
Ж. П. Алексеева, М. Л. Лобанова,
В. М. Авакумов, Т. П. Фетисова и В. М. Бере-
зовский
(53) 612.352.121 (088.8)
(56) Авторское свидетельство СССР
№ 413148, кл. А 61 К 31/525, С 07 D 487/04,
1973.

(54) ГИПОЛИПИДЕМИЧЕСКОЕ АНТИ-
СКЛЕРОТИЧЕСКОЕ СРЕДСТВО «БЕН-
ЗАФЛАВИН»

(57) Изобретение относится к медицине,
а именно к области применения гипополипе-
дического антисклеротического средства
для лечения и профилактики ИБС, клиниче-
ских проявлений атеросклероза, ожирения
в комплексном лечении инсулиннезависи-
мого сахарного диабета у больных пожилого
возраста, в терапии хронического панкреа-
тита, хронических дерматозов. Указанная
цель достигается применением 2',3',4',5'-тет-
рабензонил-5-ацетил-1,5-дигидрорибофла-
вина. Фармкомитет установил название пре-
парата — «Бензафлавин».

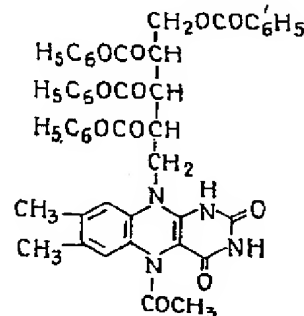
Изобретение относится к медицине, в
частности к использованию гипополипе-
дического антисклеротического средства, нор-
мализующего углеводный, липидный и энер-
гетический обмен, а также оказывающего
влияние на свертывающую систему крови
при нарушениях, вызванных эксперимен-
тальными видами сахарного диабета, атеро-
склероза и инфаркта миокарда.

В СССР для профилактики В₂-витами-
ной недостаточности применяется рибофла-
вин (Р), который при введении внутрь очень
быстро выводится из организма. Повышен-
ный уровень препарата сохраняется в крови
лишь в течение часа, а затем приходит к пер-
воначальным показателям. При хронических
заболеваниях, связанных с недостаточнос-
тью или нарушенным обменом данного вита-
мина, приводящих к нарушению самых раз-
личных сторон обмена (углеводов, липидов,
белков), требуется длительное и частое его
применение. Искан препараты, которые

удерживались бы в организме более длитель-
ное время, имеют большое актуальное зна-
чение.

Целью изобретения является использо-
вание биологически активного соединения
бензафлавина.

Данное соединение получено во
ВНИВИ — 2',3',4',5'-тетрабензонил-5-ацетил-
1,5-дигидрорибофлавин (III). Брутто-фор-
мула C₄₇H₄₀O₁₁N₄. Мол. вес 836,9. Т. п. 180°C



Оригинальное соединение (Тбза) представляет собой бледно-желтое вещество, хорошо растворимое в органических растворителях (спиртах, хлороформе, бензоле, эфирах, нейтральных жирах), что, по-видимому, обуславливает его ценные фармакологические свойства, плохо растворимо в воде. В оригинальном соединении отсутствует система 2 сопряженных двойных связей в положении 1—5, и этим оно принципиально отличается от (Р).

Оригинальное соединение 2',3',4',5'-тетрабензоил-5-ацетил-1,5-дигидрорибофлавин (Тбза) оказалось нетоксичным в острых опытах на мышах при однократном введении внутрь в виде 3 и 5%-ных солюбилизированных растворов с Твином-80 в дозах 1 и 2 г/кг (превышающих терапевтическую дозу в 200—400 раз) и в хроническом опыте на крысах.

Фармакологический Комитет МЗ СССР рекомендовал применение «Бензафлавина»

для взрослых в качестве гипополипидемического антисклеротического средства, для профилактики и лечения ИБС, клинических проявлений атеросклероза, ожирения, в комплексном лечении инсулинонезависимого сахарного диабета у больных пожилого возраста, в терапии хронического панкреатита, хронических дерматозов. Препарат «Бензафлавин» Фармкомитет рекомендует выпускать в лекарственных формах — таблетки по 0,03 и 0,04 г, покрытые оболочкой. Считать основным противопоказанием для назначения препарата индивидуальную непереносимость.

Формула изобретения

Применение 2',3',4',5'-тетрабензоил-5-ацетил-1,5-дигидрорибофлавина в качестве гипополипидемического антисклеротического средства.